第十三章　医薬関連発明

1.前言 2-13-1

2.出願の標的 2-13-1

2.1 請求項の範疇 2-13-1
2.1.1 物の請求項 2-13-1
2.1.2 方法の請求項 2-13-2
2.1.3 用途の請求項 2-13-2
2.2 法に定められた特許が与えられない標的 2-13-2
2.2.1 人間又は動物の診断、治療又は外科手術方法 2-13-2
2.2.1.1 人間又は動物の診断方法 2-13-2
2.2.1.2 人間又は動物の治療方法 2-13-5
2.2.1.3 人間又は動物の外科手術方法 2-13-7
2.2.2 審査に関する注意事項 2-13-9

3.明細書 2-13-9

3.1 明細書の記載原則 2-13-9
3.1.1 実施可能要件違反の審査 2-13-9
3.1.1.1 医薬生成物 2-13-10
3.1.1.1.1 生成物の確認 2-13-10
3.1.1.1.2 生成物の製造 2-13-11
3.1.1.1.3 生成物の用途 2-13-11
3.1.1.2 医薬方法 2-13-12
3.1.1.3 医薬用途 2-13-12
3.1.2 審査に関する注意事項 2-13-13
3.1.3 実施可能要件違反の例 2-13-14

4.特許請求の範囲 2-13-19

4.1 請求項の範疇 2-13-19
4.2 請求項の記載原則 2-13-20
4.2.1 明確であること 2-13-21
4.2.1.1 化合物に関する請求項 2-13-21
4.2.1.2 医薬組成物に関する請求項 2-13-22
4.2.1.3 医薬用途に関する請求項 2-13-23
4.2.2 簡潔であること 2-13-25
4.2.3 明細書に支持されること 2-13-25
4.2.4 審査に関する注意事項 2-13-27

5.特許要件 2-13-27
5.1 産業上の利用可能性 2-13-27
5.2 新規性 2-13-27
5.2.1 化合物に関する請求項 2-13-27
5.2.1.1 異性体、溶媒及び化合物又は結晶体 2-13-28
5.2.1.2 化合物の選択発明 2-13-29
5.2.2 医薬組成物に関する請求項 2-13-30
5.2.2.1 医薬組成物に関する新規性判断の原則 2-13-30
5.2.2.1.1 特定性質を有する 1 つの化合物又は化合物群 2-13-30
5.2.2.1.2 特定の疾患への適用に関する医薬用途 2-13-30
5.2.3 医薬用途に関する請求項 2-13-31
5.2.4 審査に関する注意事項 2-13-32
5.3 進歩性 2-13-33
5.3.1 化合物に関する請求項 2-13-33
5.3.1.1 構造類似性の判断原則 2-13-33
5.3.1.2 鏡像異性体の進歩性 2-13-33
5.3.1.3 化合物の多結晶型の進歩性 2-13-34
5.3.1.4 化合物の選択発明 2-13-36
5.3.2 医薬組成物に関する請求項 2-13-37
5.3.2.1 人間以外の動物用医薬と人間用医薬の転用 2-13-37
5.3.2.2 二以上の成分を組み合わせて調製された組成物 2-13-38
5.3.3 医薬用途に関する請求項 2-13-38
6.医薬の組み合わせ、キット及び包装の発明 2-13-39
7.発明の単一性 2-13-40
7.1 化合物に関する請求項 2-13-40
7.1.1 マーカッシュ形式の請求項 2-13-40
7.1.2 中間体及び最終生成物 2-13-41
7.2 医薬組成物に関する請求項及び医薬用途に関する請求項 2-13-44

第十三章　医薬関連発明

1.前言

本章では、医薬関連発明の審査に当たって、独特の判断及び処理を行わなければならないことに関する事項を説明する。本章が適用される発明には、単一化合物、医薬組成物、診断又は検査試薬、化粧品等医薬分野の関連発明が含まれる。

医薬関連発明の審査において、他の章節と共通する一般的規定については、他の章節を参照すること。

本章で列挙した実例は、本基準を説明するために取り上げたものに過ぎず、明細書作成の手本ではなく、尚且つ説明している特定の議題においてのみその意義を有するものであり、これに基づいて当該実例がその他の特許要件をすでに満たしていると推論してはならない。

2.出願の標的

2.1 請求項の範疇

医薬関連発明の請求項は、一般的に物の請求項及び方法の請求項に分けられる。形式上は用途の請求項である場合、その出願の標的は方法の請求項に相当すると見做さなければならない。

2.1.1 物の請求項

物の請求項は、以下の態様を含むことができる。

(1)化合物。例えば「式 I の化合物」、「式 I の化合物及びその塩」、「化合物 X の多結晶型」。

(2)組成物。例えば「医薬組成物」、「C 型肝炎を治療するための医薬組成物」。

(3)剤形。例えば「経皮吸収のパッチ」、「内服用徐放錠」。

(4)キット。例えば「C 型肝炎ウイルスを検出するキット」、「哺乳動物の肝細胞癌を治療する薬学キット」。

(5)検出装置。例えば「携帯型医療検出装置」、「近赤外線スペクトル分析を用いて非侵襲的ブドウ糖測定を行うことができる機器」。

2.1.2 方法の請求項

(1)化合物の製造方法。例えば「式 I 化合物の製造方法」。
(2)組成物の製造方法。例えば「医薬組成物の製造方法」。
(3)剤形の製造方法。例えば「内服徐放剤形を製造する方法」。
(4)検出方法。例えば「肝臓疾患のスクリーニング方法」。

2.1.3 用途の請求項

(1)化合物又は組成物を薬物の製造に用いる用途。例えば「請求項 1 の化合物を睡眠障害の治療に用いられる薬物の製造に用いる用途。」。
(2)化合物又は組成物を医療材料に用いる用途。例えば「パーフルオロアルキル基含有金属錯体をプラーク、腫瘍及び壊死組織イメージングの MR 造影のための造影剤として用いる用途。」。

2.2 法に定められた特許が与えられない標的

2.2.1 人間又は動物の診断、治療又は外科手術方法

倫理道徳の観点から、社会大衆の医療上の権益及び人間の尊厳を考慮して、医師に診断、治療又は外科手術の過程において各種方法及び条件を選択する自由が与えられる情況において、医薬に関連する方法発明が直接生命を有する人体又は動物の体を実施対象とした場合、人間又は動物の診断、治療又は外科手術方法に属し、法に定められた特許が与えられない標的となる【専 24, 24.(2)】。特許出願に係る発明が、人体から分離された試料（例えば血液、尿液、皮膚、頭髪、細胞又は組織）を生体外で処理する方法、又は当該試料を分析することによりデータを収集する方法である場合は、いずれも人間又は動物の診断、治療又は外科手術方法に属さない。

また、人体から原料を採取して生体外で医療生成物（例えば血液製剤、ワクチン、遺伝子組み換え製剤）又は医療材料（例えば、人工骨、培養された皮膚片等を含む、人体の一部分の人工代用品又は代替物）を製造する方法もまた、人間又は動物の診断、治療又は外科手術方法には属さない。

2.2.1.1 人間又は動物の診断方法

法に定められた特許が与えられない人間又は動物の診断方法は、３つの条件を含まなければならない。３つの条件とは即ち、当該方法が生命を有する人体又は動物の体を対象としていること、疾患に関する

診断であること、及び疾患の診断結果を得ることを直接の目的としていることである。

上述で言う「生命を有する人体又は動物の体を対象としていること」とは、当該方法が、生命を有する人体又は動物の体において検出又は処理を実施するもの、即ち人体又は動物の体との間で相互作用（interaction）を生じるものでなければならないことをいう。例えば、超音波によって心臓疾患を診断する方法がそれにあたる。反対に、人体又は動物の体から取得した試料の検出又は処理をインビトロで実施すること、例えば結腸癌を診断できるようにマイクロアレイ（microarray）を用いて血液試料を分析することは、これに属さない。ある方法が「生命を有する人体又は動物の体を対象としている」か否かは、その相互作用の形態や強度とは無関係であり、その実行プロセス全体（医師が病因又は病害状態を決定する精神活動は含まない）に生体が存在しさえすれば、これに属する。但し、当該方法は侵襲的な作用方式又は生体と直接接触するものであるとは限らず、例えば呼気に含まれる一酸化炭素の含有量を分析するために人の呼気を直接器材に運ぶことを含む、リアルタイムで肺機能を評価する方法は、依然として「生命を有する人体又は動物の体を対象としている」ものである。

上述で言う「疾患に関する診断であること」とは、当該方法が疾患の診断と関係のあるものでなければならないことをいう。疾患の診断とは関係のない方法又は単に人間又は動物の特性を測定するに過ぎない方法例えば身長、体重又は皮膚等を測定する方法である場合、いずれも法に定められた特許が与えられない標的には属さない。

上述で言う「疾患の診断結果を得ることを直接の目的としていること」とは、当該方法が、人間又は動物の健康状態を理解してその病状を把握するために、測定データの取得から診断を下すまでのすべての工程、即ち生命を有する人体又は動物の体を検出すること（即ち実測値の測定）、症状を評価すること（即ち、測定値と基準値の差の比較）及び病因又は病害状態を決定すること（前述した差によって生じる診断結果の推定）を含むプロセス全体を包括する具体的な最終診断結果を獲得することができなければならないことをいう。人間又は動物の診断と関係のある方法の発明を判断する場合は、当該発明が形式上、以上のすべての工程を含むか否かを考慮しなければならないのみならず、当該発明が実質的に以上のすべての工程を含むか否かを更に見極めなければならない。例えば、生命を有する人体からある生理的パラメータを測定して得る方法の発明では、その形式上は疾患の診断結果を得ることを直接の目的としてはいないものの、もし先行技術における医学知識に基づいて当該パラメータから疾患の診断結果が直接得ら

れる場合は、当該発明を中間結果が得られるものに過ぎないとしてはならず､依然として専利法第 24 条第 2 号に規定される人間又は動物の診断方法に属する。

反対に、たとえ方法の最終目的が疾患を診断することであったとしても、もしその直接の目的が疾患を診断することではない場合、例えば X 線照射方法、血圧測定方法等において、それによって得られる情報が中間結果に過ぎず、疾患の診断結果を直接知ることができない場合は、法に定められた特許が与えられない標的には属さない。特許出願に係る発明が人間又は動物の診断方法に属するか否かの判断は、当該方法が上述した定義を満たしているか否かと関係があり、当該方法が誰によって実行されるか又は医師が立会うこと若しくは責任を負うことを必要とするか否かとは関係がない。

例 1.

〔特許請求の範囲〕

ヒトが腎臓疾患に罹患しているか否かを検出する方法において、

(1)腎臓疾患に罹患していると思われる患者から尿液試料を取得する工程と、

(2)抑制剤タンパク質 X の前記試料内での濃度をインビトロで測定する工程と、

(3)工程(2)で得られた濃度及び正常者の尿液中における抑制剤タンパク質 X の濃度を比較する工程と、

(4)前記尿液試料の抑制剤タンパク質 X の濃度が正常濃度よりも遥かに低い場合､腎臓疾患に罹患している可能性を示す工程と、

を含むことを特徴とするヒトが腎臓疾患に罹患しているか否かを検出する方法。

〔説明〕

特許出願に係る方法には、測定データの取得から診断を下すまでのすべての工程が含まれているが、当該方法は患者から取得した試料をインビトロで検出するものであって、直接生命を有する人体を対象とはしていないため、人間又は動物の診断方法には属さない。

例 2.

〔特許請求の範囲〕

心臓造影方法であって、

(1)心臓血流経路を有する個体を磁気共鳴イメージング（MRI）システムに入れる工程と、

(2)極性化した ^{129}Xe を前記個体に送る工程と、

(3)標的領域の少なくとも 1 つの大角度の無線周波数に沿ってパ

ルス波刺激を行う血流経路において、一部極性化した ^{129}Xe を溶解（dissolve）する工程と、

(4)刺激、溶解した極性化した ^{129}Xe を結合した磁気共鳴イメージを生成する工程と、

を含むことを特徴とする心臓造影方法。

〔説明〕

明細書には、当該方法が造影又はスペクトル信号の方式でデータを取得した後、診断を下すのに用いられることが開示されているが、特許出願に係る方法は、検出段階にのみ限られ、症状を評価すること及び病因又は病害状態を決定することの後続工程を欠いており、何らかの重要な偏差を見出すために、取得したデータを基準値と比較すること、及び前述した差によって生じる診断結果を推定する工程がないため、測定データの取得から診断を下すまでのすべての工程が含まれておらず、人間又は動物の診断方法には属さない。

2.2.1.2 人間又は動物の治療方法

法に定められた特許が与えられない人間又は動物の治療方法とは、生命を有する人体又は動物の体に健康を回復させたり健康を獲得させることを目的とした､疾患を治療する又は病因を除去する方法をいい、更に例えば疾患を預防する方法、免疫の方法といった、治療を目的とした又は治療性質を有するその他の方法をも含む。また、例えば薬物依存又は依存からの回復の過程において生じる不感蒸泄、吐き気等の症状に対する処理方法といった、痛み、不快感又は機能喪失等の症状を和らげたり軽減する方法もまたこれに属する。

特許出願に係る発明が人間又は動物の治療方法に属するか否かについての判断原則は診断方法とは異なり、方法においてある１つの工程の技術的特徴が疾患の治療に用いられると共に生命を有する人体又は動物の体に実施されていさえすれば、たとえ当該方法に他の非治療工程が更に含まれていたとしても、当該方法発明は、人間又は動物の治療方法に属する。

特許出願に係る発明が法に定められた特許が与えられない治療方法及び特許を与えることができる非治療方法を包括している場合、例えば、「化合物 X 及び Y を含有するキャリアに血液を接触させることを特徴とする凝血を抑制する方法」は、その範囲に患者の身体の血液を処理することが治療方法の一部（法に定められた特許が与えられない標的）として含まれ､瓶中に保存された血液を処理する非治療方法（特許を与えることができる標的）も含まれていることから、依然として人間又は動物の治療方法に属するものであり、特許を与えてはならな

い。但し、明細書の記述によって、請求される方法が非治療方法とのみ関係があることが明確に理解することができる場合は、特許請求の範囲において、請求される方法を非治療方法として明確に限定しなければならない。従って、前述した特許請求の範囲を例えば「凝結を抑制するために、化合物 X 及び Y を含有するキャリアに血液を接触させることを含むことを特徴とする、瓶中に保存された血液を処理する方法」に補正しなければならない。

特許出願に係る方法が治療及び非治療の効果を同時に奏し、且つ双方の効果が不可避的に連結されて区別することができない場合、依然として人間又は動物の治療方法に属する。例えば、化合物 X を用いて歯のプラークを除去する方法では、明細書には当該方法がプラークを除去して歯の外観を改善する美容効果を有することが開示されているが、当該方法が虫歯を予防すること及び歯肉疾患の治療効果を不可避的に同時に奏し、且つその双方の効果を区別することができない場合は、人間又は動物の治療方法に属する。反対に、ある方法の治療及び非治療効果を明確に区別することができ、且つ特許請求の範囲において当該方法が非治療の目的に用いられることが明確に限定されている場合は、人間又は動物の治療方法に属さない。例えば、体重を軽減する方法は、美容に用いられる非治療効果及び肥満症の治療に用いられる治療効果を含む可能性があるが、もし特許請求の範囲に記載された技術的特徴が、特定の個体群を対象とすること又は特定の投与量範囲で使用することにあり、それによって奏する効果が単に体重を軽減することであって肥満症を治療することではなく、双方の効果を明確に区別することができる場合は、人間又は動物の治療方法に属さない。

原則として、一般的な避妊方法は人間又は動物の治療方法に属さない。妊娠自体は疾患ではないからであるが、しかし治療を目的とした避妊方法である場合又は避妊方法に区別できない治療効果が伴う場合は、人間又は動物の治療方法に属する。例えば、避妊の目的のために服用される化合物 A 及び化合物 A の服用によって生じる副作用を予防するための化合物 B を含むことを特徴とする避妊方法は、化合物 A の服用が治療の目的に属さないものの、化合物 B の服用が疾患を予防する治療の目的に関わるため、当該方法の全体は依然として人間又は動物の治療方法に属する。

特許出願に係る方法の技術的特徴は、例えば埋め込み（移植物）である非生体標的物に直接作用するが、当該方法が埋め込みを介して生体に対して治療の目的又は効果を奏し得る場合、人間又は動物の治療方法に属する。例えば、心臓ペースメーカーを操作する方法の特徴が、心臓ペースメーカーを調整することによって心臓が血液を送り出す量

を制御することである場合は、治療方法に属する。しかしながら、もし当該方法が心臓に対して刺激作用を生じておらず、単にペースメーカーの送り出しエネルギーを制御するに過ぎない場合、その目的はペースメーカーのエネルギー消費を調整して最適化することによって、その装置のエネルギー需要を低減することであるが、心臓の送り出しエネルギーに影響を及ぼすものではなく、その特徴は実質的に埋め込みに対する技術操作であって、その装置は生体に生じる治療効果とは機能上の関連性がないため、当該方法は人間又は動物の治療方法には属さない。

特許出願に係る発明が、頭髪、皮膚の美化又は身体外観の改善に関わる方法を含む、生命を有する人体又は動物の体に化学生成物を使用する単純な美容処理方法である場合は、人間又は動物の治療方法に属さない。例えば、頭髪の巻き髪の程度を保持する処理方法及びネイルカラーリングの方法がそれに当たる。

例.

〔特許請求の範囲〕

効果的に被覆する日焼け止め組成物 A を局部に使用することを含む、人間の皮膚を UVA 及び UVB 波長の放射線作用から保護する方法。

〔説明〕

日焼け止め組成物 A によって、人間の皮膚を UVA 及び UVB 波長の放射線作用から保護することができると共に、紅斑、老化症及び皮膚癌を予防することができる旨開示されている。

〔結論〕

出願の標的は「人間の皮膚を UVA 及び UVB 波長の放射線作用から保護する方法」に限定されており、治療の目的には属さないが、明細書には請求される方法を紅斑、老化症及び皮膚癌の予防に用いることができる旨別途開示されており、人間又は動物の治療方法に属する。この日焼け止め組み合わせ物を皮膚に使用した場合、日焼け止めの非治療効果を達成することができるのみならず、同時に上述した疾患を予防する治療効果をも達成することができ、且つこの双方の効果は区別することができないため、請求される方法は人間又は動物の治療方法に属する。

2.2.1.3 人間又は動物の外科手術方法

法に定められた特許が与えられない人間又は動物の外科手術方法とは、器具を用いて生命を有する人体又は動物の体に対して切開、切除、縫合、刺青、注射及び採血等を実施する外傷的又は介入的な治療又は処理方法をいう。当該方法は、生命を有する人体又は動物の体の生物

体構造に対して意図的に介入又はそれを破壊するものであり、近視レーザー手術、歯科手術、内視鏡検査、カテーテル導入の方法及び診断、治療を目的としない美容、整形（例えば二重切開、脂肪吸引、豊胸）等の方法を含む。例えば皮膚消毒、麻酔といった、外科手術のために採用される予備的処理方法も外科手術方法に含まれる。生命を有する人体又は動物の体を対象とせずに外科手術を実施する方法は、法に定められた特許が与えられない外科手術方法に属さない。

特許出願に係る発明が人間又は動物の外科手術方法に属するか否かについての判断原則は診断方法とは異なり、特許出願に係る方法が複数の工程を含む場合、そのうちの１つの工程が生命を有する人体又は動物の体に実施するものでありさえすれば、たとえ当該方法に他の非外科手術の工程が更に含まれていたとしても、当該方法発明は、依然として人間又は動物の外科手術方法に属する。

特許出願に係る発明が外科手術によってある装置を生体に埋め込む（インプラントする）又は挿入する方法である場合は、人間又は動物の外科手術方法に属する。しかしながら、単に埋め込み装置を操作する方法、又は埋め込み装置と外部の使用者若しくは埋め込み装置とシステムとの間の相互作用方法であって、当該方法が装置の埋め込み方式とは無関係であり、且つ生体上において作用するものでない場合、当該方法発明は、人間又は動物の外科手術方法には属さない。

例.

〔特許請求の範囲〕

心臓造影方法であって、

(1)心臓血流経路を有する個体を磁気共鳴イメージング（MRI）システムに入れる工程と、

(2)極性化した ^{129}Xe を前記個体に送る工程と、

(3) 標的領域の少なくとも１つの大角度の無線周波数に沿ってパルス波刺激を行う血流経路において、一部極性化した ^{129}Xe を溶解（dissolve）する工程と、

(4)刺激、溶解した極性化した ^{129}Xe を結合した磁気共鳴イメージを生成する工程と、

を含むことを特徴とする心臓造影方法。

〔説明〕

請求項の工程(2)は「極性化した ^{129}Xe を前記個体に送る」ことである。しかし明細書には、極性化した ^{129}Xe を注射又は類似の方法で直接心臓領域まで送ることが記載されており、これは、生体に対して施行される介入的な工程であるため、工程(2)は外科手術工程に属し、特許出願に係る方法の全体は人間又は動物の外科手術方法に属する。

2.2.2 審査に関する注意事項

(1)特許出願に係る発明が法に定められた特許が与えられない「人間又は動物の診断、治療又は外科手術方法」を構成するか否かについては、特許請求の範囲の標的名称が「方法」であるか否かによって判断しなければならない。物を標的名称とする請求項は、たとえその用途が診断、治療又は外科手術方法に用いられるものであっても、依然として物の発明に属し、上述した法に定められた特許が与えられない方法には属さない。例えば特許請求の範囲の標的名称が「医薬組成物」又は「キット」である場合は、いずれも物の発明に属し、たとえ記載される技術的特徴が投与量、投与経路、投与間隔、異なる成分を前後して使用することといった投与方法に関するものであったとしても、それらの標的名称が上述した法に定められた特許が与えられない方法に属さないため、専利法第 24 条第 2 号の規定をもって拒絶するべきではない。

(2)人間又は動物の診断方法に属するか否かの判断においては、まず請求項に 2.2.1.1 第四段落で述べたすべての工程が含まれているか否かを確認しなければならず、もし請求項においてそのうちのある工程が省略されており、且つ当該工程がその発明にとって必要なものである場合、特許請求の範囲に技術課題を解決するためのすべての必要な技術的特徴が記載されておらず、特許出願に係る発明を明確且つ完全に特定することができないことを理由に、専利法第 26 条第 2 項の規定に違反するとして拒絶しなければならない。

3.明細書

3.1 明細書の記載原則

明細書の記載は、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が明細書、特許請求の範囲及び図面の三者全体に基づいて、出願時の通常の知識を参酌することで、過度の実験を行わなくとも、その内容を理解し、それに基づいて特許出願に係る発明を製造及び使用して、課題を解決することができるとともに、予期する効果を奏することができるように、特許出願に係る発明を明確且つ十分に開示しなければならない【専 26.I】。

3.1.1 実施可能要件違反の審査

審査官は、出願時の明細書に開示された内容に基づくとともに、出

願時の通常の知識を参酌することによって特許出願に係る発明が過度の実験を経ることなくそれに基づいて当該発明を実施することができるか否かを判断しなければならない。過度の実験が必要か否かの評価においては、第一章 1.3.1「実施可能要件」で述べた各項要素、即ち特許請求の範囲の広さ、特許出願に係る発明の本質、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者の一般知識及び普通の技能、所属する技術分野における発明の予測可能の程度、先行技術に述べられた数量や開示内容に基づいて特許出願に係る発明を製造及び使用するのに要する実験の数を含む明細書で提示された数量（amount of direction）といった要素を考慮しなければならない。もしその発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が明細書、特許請求の範囲及び図面の三者全体に基づいて、出願時の通常の知識を参酌しても、過度の実験を経なければ特許出願に係る発明のすべての範囲を製造及び使用することができない場合は、特許出願に係る発明が実施可能要件に違反していると認定する。

3.1.1.1 医薬生成物

医薬生成物の発明は、主として医薬用途に用いられる化合物及び医薬組成物を含む。組み合わせ、キットといったその他の医薬生成物の発明については、本章 6.「医薬の組み合わせ、キット及び包装の発明」を参照のこと。

特許出願に係る発明が医薬生成物である場合、明細書において医薬生成物の確認、製造及び用途を記載しなければならなず、そのポイントは当該生成物を如何にして製造及び使用するかにある。医薬発明が属する技術分野では、通常その生成物自体の構造からでは当該生成物を如何にして製造及び使用するかを推論することが困難であるため、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者がその内容を理解することができると共にそれに基づいて当該発明を実施することができるように、明細書には通常１つ又は複数の代表的な実施形態又は実施例を記載して、当該生成物が如何にして製造され如何にして使用されるかについて説明しなければならない。

3.1.1.1.1 生成物の確認

化合物の発明については、請求される化合物を明細書において明示しなければならない。即ち、当該化合物の化学名称、構造式（各種官能基グループ、分子立体構造等を含む）又は分子式を明記すると共に、当該化合物の物理的、化学的性質（例えば各種定性、定量データ或ス

ペクトル図等）を記載しなければならない。明細書の記載は、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が当該化合物を確認できる程度まで明確且つ十分に開示されなければならない。

組成物の発明については、明細書にその成分、各成分の選択可能な範囲及び含有量範囲、並びに組成物の性質又は機能に対する影響を明確に記載しなければならない。２種類又は２種類以上の活性成分がある場合は、その組成比を記載しなければならない。組成比の記載においては、重量、重量分、重量割合、重量パーセント又はその範囲等を含む具体的な用量又は比率で表示することができる。組成物中に新規な成分が含まれている場合は、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者がその内容を理解することができると共にそれに基づいて実施することができるように、その成分の製造方法を記載しなければならない。

構造及び／又は組成だけでは明瞭に記述することができない生成物については、特許出願に係る生成物が明瞭に確認され得るように、明細書において適切な物理的、化学的性質及び／又は製造方法を用いて更に説明を加えなければならない。

3.1.1.1.2 生成物の製造

医薬生成物の発明については、明細書において少なくとも１つの製造方法を記載して、当該方法の実施に要する原料、製造工程及び条件（例えば反応温度、圧力等）等を説明しなければならない。

3.1.1.1.3 生成物の用途

特許出願に係る発明が医薬に用いられる化合物である場合、明細書において、例えば適用される疾病又は薬理作用といったその医薬の用途を記載すると共に、その有効投与量及び使用方法を記載しなければならない。その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が出願時の通常の知識からでは主張される医薬用途を当該発明が有することを確認又は推論することができない場合、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者にとって当該発明で主張される医薬用途を証明するに足る薬理試験方法及び結果を記載しなければならない。

特許出願に係る発明が医薬組成物である場合、明細書において、例えば適用される疾病又は薬理作用といったその医薬の用途を記載すると共に、その有効投与量、使用方法、及びその発明の属する技術分野

における通常の知識を有するにとって当該発明で主張される医薬用途を証明するに足る薬理試験方法及び結果を記載しなければならない。

原則として、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者がその内容を理解することができると共にそれに基づいて実施することができるように、薬理試験の記載には、当該試験を行う上で使用された方法及び薬理試験と発明で主張された医薬用途との関連性についての記述が含まれなければならない。

上述した薬理試験を行う上で使用された方法には、使用された化合物、投与量、投与経路、テスト若しくは分析方法又は製剤方法、試験結果等が含まれなければならない。薬理試験の結果は、通常、数値データで記載されなければならず、数値データで記載することができない場合は、数値データに相当する、受け入れられる客観的な記載を提供することができる。例えば特許出願に係る発明が挫創を治療する医薬組成物である場合、明細書には、当該医薬組成物を患者の顔に使用すると、その皮膚の赤い腫れ及び炎症反応がすでに軽減されたという観察結果を記載しなければならない。

薬理試験においては、例えば生体外試験、動物実験又は臨床試験といった、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が普遍的に採用する科学的方法を採用しなければならない。

3.1.1.2 医薬方法

特許出願に係る発明が化合物又は医薬組成物の製造方法である場合、明細書において、原料、製造プロセス及び生成物を含む、当該発明を実施する製造技術の内容を記載しなければならない。原料部分には、各成分及び混合比（用量又は割合）が含まれる。製造プロセス部分には、製造工程及びパラメータ条件（例えば温度、時間、pH 値等）が含まれる。

3.1.1.3 医薬用途

特許出願に係る発明が医薬用途である場合、明細書において、使用する生成物、医薬用途（例えば適用される疾病又は薬理作用）、有効投与量及び使用方法等を記載しなければならず、またその発明の属する技術分野における通常の知識を有する者にとって、当該生成物が発明で主張される医薬用途に用いることができることを証明するに足る薬理試験方法及び結果を記載しなければならない。薬理試験の記載方式については本章 3.1.1.1.3「生成物の用途」を参照のこと。

3.1.2 審査に関する注意事項

(1)特許出願に係る発明について審査の結果、実施可能要件に違反していると認定した場合、審査官は当該発明がそれに基づいて実施できない理由を明記しなければならない。出願人は、明細書の記載に基づけば、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が、出願時の通常の知識を参酌することで、過度の実験を行わなくとも、その内容を理解することができ、それに基づいて特許出願に係る発明を製造及び使用することができることを示す証拠として、応答説明、関連文献又は技術内容に関する補充説明若しくは実験結果等のデータを提出することができる。但し、明細書において新たな実施形態、実施例又は実験データを追加してはならない。

(2)特許出願に係る発明が医薬用途(医薬組成物及び医薬用途に関する請求項を含む)に関わる場合、原則として、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者にとって、当該発明で主張された医薬用途を証明するに足る薬理試験方法及び結果を提供しなければならない。出願時の明細書に薬理試験を行う方法及び薬理試験の結果が一切記載されていない場合は、当該発明は実施可能要件に違反する。たとえ出願人が審査意見通知書を受領した後で薬理試験結果の書面データを別途提出したとしても、原明細書に薬理試験を行う方法が一切記載されていないため、出願日の後に提出された薬理試験結果は、それをもって出願時の明細書においてすでに当該医薬発明が、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が実施できる程度にまで明確且つ十分に開示されていたことを証明することはできないから、拒絶理由を解消することはできない。反対に、明細書において、例えば使用する化合物、投与量、投与経路、テスト若しくは分析方法又は製剤方法といった薬理試験を行う具体的な方法がすでに詳細に記載されていた場合は、薬理試験の結果が記載されていない又は記載が不完全であるものの、出願人が十分に開示してそれに基づいて実施することができることに違反するとの拒絶理由を解消するために、応答説明時に、薬理試験結果を含むデータ又は関連文献を提出した場合、審査の際には、当該試験が明細書の記載内容と一致する実験方法（例えば同一の化合物及び薬理試験方法）を使用しているか否かについて注意しなければならない。また、それらのデータは当初開示された発明が確かにそれに基づいて実施できることの証明としてのみ用いられるに過ぎず、当初明細書に組み込まれてはならない。

(3)明細書において薬理試験に用いられた化合物が明記されていない場合、特許出願に係る発明の薬理作用を確認することができない。

例えば出願時の明細書に記載された薬理試験に使用された化合物が、「任意の本発明の化合物」とのみ記載されているに過ぎず、具体的にどの化合物を使用したのかが明示されていない場合は、特許出願に係る発明の薬理作用を確認することができず、特許出願に係る発明は実施可能要件に違反している。

3.1.3 実施可能要件違反の例

例 1.

その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が、明細書に開示された内容に基づいて、過度の実験を行わなければ特許出願に係る発明を「製造」することができない。

〔特許請求の範囲〕

【請求項１】

X 受容体を活性化することができる化合物であって、

(1)候補化合物を、細胞表面で前記 X 受容体を発現することができる細胞と接触させる工程と、

(2)前記候補化合物が X 受容体を活性化するか否かを判断する工程と、

を含むスクリーニング方法によって得られることを特徴とする X 受容体を活性化することができる化合物。

【請求項２】

肥満を抑制することができる医薬組成物であって、X 受容体を活性化することができる化合物を活性成分として含み、前記化合物が請求項 1 に記載のスクリーニング方法によって得られることを特徴とする肥満を抑制することができる医薬組成物。

〔説明〕

明細書において、新規な X 受容体及び X 受容体を活性化する能力を有する化合物をスクリーニングする方法が開示されていると共に、並当該化合物が肥満を抑制する効果を奏することを見出したことが記載されている。

明細書には更に、X 受容体を活性化することができる化合物をスクリーニングする詳細として、化合物が X 受容体を活性化することができるか否かを検査する方法が含まれることが開示されていると共に、当該方法でスクリーニングして X 受容体を活性化することができる化合物 A、B、C を得る実施例が提供されている。明細書には更に、肥満を抑制する薬学的機序理論及び化合物 A が薬理効果を有することを示す具体的な薬理試験結果が開示されているが、化合物 A、B、C 以外の新規な化合物の化学構造的特徴又は製造方法は記載されていない。

〔結論〕

請求項 1 は、「X 受容体を活性化することができる」という予期される性質により化合物を特定することに関する。予期される性質のみで化合物を特定することは、通常、特定の性質を有する化合物を確認するのが困難である。明細書において化学構造等の核となる情報が提供されていない場合、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者は、過度の実験を行わなければ、多くの化合物を製造すると共に当該特定の性質を有する化合物をスクリーニングで得ることができない可能性がある。

その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者は、明細書に開示された方法を運用して化合物 A、B、C のスクリーニングを行うことができるものの、明細書には化合物 A、B、C 以外の他の活性化合物の主要情報（例えば、化学構造）が開示されていないため、化合物 A、B、C の化学構造からでは他の当該特定機能性質を有する活性化合物の化学構造を推知することができず、その化学構造特徴と X 受容体を活性化することができる機能との関係が分からない。従って、請求項 1 の特許出願に係る化合物はランダムスクリーニングの方式で得られるものであり、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者は、過度の実験を行わなければ、特定性質を有する化合物を製造すると共にスクリーニングで得ることができない。故に請求項 1 は、実施可能要件を満たしていない。

請求項 2、X 受容体を活性化することができる化合物を活性成分として含む医薬組成物に関する。X 受容体は是出願人が最初に発見したものであり、且つ X 受容体を活性化することができる活性成分は、出願時点ではその技術分野における通常の知識ではなかった。しかしながら、その明細書にはその発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が請求される活性成分が何であるかを理解することができる程度にまで記載されておらず、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者は、過度の実験を行わなければ、特定性質を有する活性成分をスクリーニングで得ることができない。故に請求項 2 は、実施可能要件を満たしていない。

例 2.

その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が、明細書に開示された内容に基づいて、過度の実験を行わなければ特許出願に係る発明を「使用」することができない。

〔特許請求の範囲〕

成分 A を制吐薬の製造に用いる用途。

〔説明〕

明細書に記載された成分 A 自体は既知の化合物であり、特許出願に係る発明は成分 A の新たな用途である。明細書には薬理試験を行う方法及び薬理データは一切記載されていない。出願時の通常の知識及び出願時の明細書に記載された作用効果からでは、成分 A が制吐の効果を有することを推論することができない。

〔結論〕

請求項は、成分 A を制吐薬とする用途に関する。その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者は、通常、化合物の名称及び化学構造のみからではその医薬用途を予測することは困難である。明細書には薬理試験を行う方法及び結果が記載されていないため、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が明細書の記載のみからでは当該発明が当該医薬用途に用いることができることを確認できない場合、たとえ出願時の通常の知識及び明細書に記載された作用機序等の説明を考慮したとしても、成分 A が制吐の効果を有することを推論することができなければ、明細書は十分に開示されていないものであり、そのためその発明の属する技術分野における通常の知識を有する者がその内容を理解すると共にそれに基づいて実施することができない。

一般的に言えば、出願人が応答時に成分 A が制吐効果を有することに関する薬理試験方法及び薬理データの書面データ又は実験結果を追完しても、原拒絶理由を解消することはできない。なぜなら、「明細書は、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者がその内容を理解することができると共にそれに基づいて実施することができるように、明確且つ十分に開示されなければならない」ことの判断は、出願時の明細書の記載に基づくからである。従って、当該明細書の記載を審査する場合、たとえ出願時の通常の知識を考慮しても、依然として成分 A が制吐の効果を有することを確認又は推論することができない場合、出願日の後にその効果が確認されたとしても、依然として出願時の明細書が当該制吐用途の発明をその発明の属する技術分野における通常の知識を有する者がそれに基づいて実施することができる程度にまで明確且つ十分に記載していることを証明することはできない。

例 3.

〔特許請求の範囲〕

ワクチンであって、

(a)「Met-Ala-Ala……」のアミノ酸配列からなるタンパク質と、

(b)(a)の薬学上許容されるキャリアと、
からなることを特徴とするワクチン。

〔説明〕

明細書には、(1)ヒト免疫不全ウイルス（HIV）由来の、「Met-Ala-Ala……」アミノ酸配列を含有するタンパク質Aを符号化するDNAをどのようにして確認すると共に単離するか、(2)当該DNAによって符号化されたタンパク質Aの発現を確認すると共に当該タンパク質Aを得ること、(3)当該タンパク質Aをラットに投予することで、当該タンパク質Aと拮抗する抗体を生成することができること、が具体的に記載されている。しかしながら、明細書には、タンパク質Aと拮抗する抗体中に中和性抗体の存在が含まれることが記載されておらず、タンパク質Aのワクチンとしての機能を示す薬理データも提供されていない。更に、出願時の通常の知識及び出願時の明細書におけるタンパク質Aの作用に関する説明からでは、「HIV由来のタンパク質A」がワクチンとしての機能を有することを推知することができない。

〔結論〕

明細書には、タンパク質Aのワクチンとしての機能を示す薬理データが具体的に記載されておらず、タンパク質Aと拮抗する抗体がHIVの活性を中和することも記載されていない。また、当該発明の出願時の通常の知識では、タンパク質Aとの高い相同性（homology）を有するアミノ酸配列を含有するタンパク質がHIVのワクチンとし得ることを証明することができない。従って、明細書の記載からでは、タンパク質Aを明確な薬理効果を有するワクチンとなし得ることを証明することはできない。

出願人が応答時に提出薬理試験方法及び薬理データの書面意見又は実験結果を提出することによってタンパク質Aのワクチンとなし得る機能を主張しても、通常、上述した拒絶理由を解消することはできない。なぜなら、「明細書は、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者がその内容を理解することができると共にそれに基づいて実施することができるように、明確且つ十分に開示されなければならない」ことの判断は、出願時の明細書の記載に基づくからである。また、明細書において、HIV由来のタンパク質Aのワクチンとなし得る機能について、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が確認又は推論することができる程度まで記載されていない場合、出願日後に当該機能を確認することができたとしても、依然として出願時の明細書において当該ワクチンの発明がその発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が実施することができる程度まで明確且つ十分に開示されていたことを証明することはできない。

通常、タンパク質 A のワクチンとしての機能を証明するには、まずタンパク質 A を動物（例えばラット）に投予しなければならず、且つ当該動物がタンパク質 A を外来物質と認識し、その体内においてタンパク質 A と拮抗する抗体を生成すること、即ち単に「免疫原性」を有することのみでは、ワクチンとしての機能を証明するには不十分であり、「当該抗体がタンパク質 A の活性部位に作用することによって HIV の活性を阻害すること」を証明しなければならない。しかしながら、物質活性を阻害する抗体、即ち中和抗体については、当該物質中に僅か少量のみ存在する中和性抗原決定基を識別しなければならないため、通常このような抗体を生成し得る可能性は低い。従って、タンパク質 A が投予された動物体内において、タンパク質 A 中に存在するか否かが確認されていない「中和性抗原決定基」を識別し得る抗体が生成される可能性は低いと考えられる。

例 4.

〔特許請求の範囲〕

下記一般式(I)で表される化合物を X 受容体拮抗剤の製造に用いる用途。

【化１】

$R\text{-}O\text{-}C_6H_4\text{-}CH(CH_3)\text{-}COOH$　　(I)

（式中、R は水素、C_1-C_{20} アルキル基又は 1-3 環を有する芳香族基を表す。）

〔説明〕

明細書において、特許出願に係る発明が一般式(I)で表される化合物を X 受容体拮抗剤とする新たな用途に関することが開示され、且つ X 受容体拮抗剤に関する作用を確認する薬理試験方法及び薬理データが記載されており、一般式(I)で表される化合物の置換基 R を水素とするデータのみがある。

〔結論〕

一般的に、出願時の通常の知識によって、X 受容体拮抗剤の拮抗作用を導入するために、フェニレン基に隣接する酸素を受容体の対応部分と結合させなければならないことが知られている。また、特許出願に係る発明において、一般式(I)で表される化合物の置換基 R の大きさは、通常、X 受容体の親和性に著しく影響を及ぼす。これにより、出願時の通常の知識では、たとえ一般式(I)で表される化合物の置換基 R の大きさを大小を変更しても、それによってもたらされる X 受容体の活性は依然として同様であると主張することは困難であり、且つ明細

書における一般式(I)で定義されるすべての化合物が、実施例として開示された化合物と同様のX受容体拮抗作用を有することを証明することはできない。

出願人が応答理由書においてデータを提供することにより、一般式(I)で表される化合物のRが水素以外の置換基（より大きな置換基を選択しなければならない）である場合でも、X受容体拮抗作用と実施例において化合物が奏する作用の程度とが同一であることを立証できれば、上述した拒絶理由を解消することができる。

また、出願人は、出願時の通常の知識を前提として、理由を明示して審査官の拒絶理由が誤りであることを指摘することもできる。即ち、先行技術文献を引用して、その技術分野における通常の知識から考えて、置換基Rの大きさがX受容体の親和性に対して影響を及ぼさないことを説明し、仮にそれによって出願人の主張が適切であることを確認することができれば、上述した拒絶理由は解消される。

4.特許請求の範囲

4.1 請求項の範疇

医薬関連発明の請求項の範疇は、物の請求項及び方法の請求項に区別することができる。例えば「化合物Aの胃疾患を治療する用途」といった形式上は用途の請求項である場合は、「化合物Aを用いて胃疾患を治療する方法」という方法の請求項と見做さなければならない。

医薬関連発明の分野において、物の請求項には、化合物、医薬組成物、剤形（例えば錠剤、坐剤及びアンプル剤等）、キット（kit）、包装（package）又は組み合わせ（combination）等の出願の標的が含まれる。

特許出願に係る発明が化合物又は組成物を人間又は動物の診断、治療又は外科手術に用いる目的に関するものである場合は、用途（又は使用、適用）を出願の標的とする医薬用途に関する請求項は、方法の請求項と見做されるため、請求項を「化合物Aの治療疾患Xを治療する用途。」として作成した場合は、「化合物Aを用いて疾患Xを治療する方法」と見做され、人間又は動物の治療方法に属するものとして、特許を与えてはならない。しかしながら、例えば「化合物Aの薬物としての用途。」、「化合物Aの疾患Xを治療する薬物の製造における用途。」又は「疾患Xを治療する薬物の製造に用いられることを特徴とする医薬組成物Bの用途。」等の作成形式に改めて作成した場合は、法に定められた特許が与えられない標的には属さない。このうち、「化合物Aの疾患Xを治療する薬物の製造における用途。」又は「疾患Xを治療する薬物の製造に用いられることを特徴とする医薬組成物Bの

用途。」等の作成形式による医薬用途に関する請求項は、スイスタイプクレーム（Swiss-type claim）と呼ばれ、その出願の標的は、製造薬物を製造する方法と見做され、人間又は動物の治療方法に属さない。

治療方法に関わる方法の請求項又は用途の請求項、例えば「化合物 A を用いることを特徴とする疾患 X を治療する方法」又は「化合物 A の疾患 X の治療に用いる用途。」が、スイスタイプクレームとして「化合物 A の疾患 X を治療する薬物の製造に用いられる用途。」に補正された場合、出願時の明細書、特許請求の範囲又は図面に開示された範囲を超えるものとは見做さない。

スイスタイプクレームは、「化合物」又は「組成物」の医療用途に用いる出願を薬物製造の用途に用いる出願に改めるものであり、人間又は動物の治療方法に関わることを回避するための特殊な作成方式である。従って、スイスタイプクレームはそれら方法の用途にのみ限られ、例えば外科手術によって実行されるものではない美容方法又は衛生保健方法といった非医療用途の出願は、上述した法に定められた特許が与えられない標的に関わるものではなく、スイスタイプクレームの形式で作成してはならず、一般的な用途の請求項又はその他の方式で作成しなければならない。

また、医療器材、装置又は機器（例えば手術器材）は、「化合物」又は「組成物」ではなく、「薬物製造」の用途とすることができないため、スイスタイプクレームの作成方式で新規な医療用途（例えば手術用途）として出願せざるを得ない。

スイスタイプクレームの特許請求の範囲は薬物を製造する方法と見做される。従って、たとえその記載が、例えば投与量、投与経路、投与間隔、異なる成分を前後して使用することといった投与方法に関わるものであったとしても、その出願の標的が人間又は動物の治療方法に属さないことから、専利法第 24 条第 2 号の規定によって拒絶するべきではない。

4.2 請求項の記載原則

特許権（発明専利権）の範囲は、特許請求の範囲を基準とし、特許請求の範囲は、特許出願に係る発明が特許要件を備えるか否かを判断するための審査対象である。従って、特許請求の範囲は、特許出願に係る発明を特定しなければならず、一項以上の請求項を含むことができ、各請求項は明確、簡潔な方式で記載されなければならず、且つ明細書に支持されることを必要とする【専 26.II】。これについては、第一章 2.4「請求項の記載原則」を参照のこと。

4.2.1 明確であること

原則として、物の技術的特徴は、構造で特定しなければらなず、構造ではっきりと特定することができない場合にかぎって､機能､特性、製造方法又は用途で特定することができる。但し、請求項の記載は明確でなければならない。これについては、第一章 2.4.1「明確であること」を参照のこと。

4.2.1.1 化合物に関する請求項

特許出願に係る発明が化合物である場合、化合物の機能又は特性によってその構造を予測することが困難であるため、原則として化学名称又は分子式、構造式等の構造特徴によってその請求項を特定しなければならない。化学名称又は分子式、構造式によって特定することができない場合は、物理的、化学的特性（例えば融点、分子量、スペクトル、pH 値等）によって特定することができる。物理的又は化学的特性によってもなお特定することができない場合は、製造方法によって特定することができる。但し、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者がその出願の標的と先行技術との区別を十分認定することができるように、請求項において先行技術とは異なる必要な技術的特徴を記載しなければならない。また、特殊な機能又は用途があり、尚且つその技術的特徴を十分に示すことができる場合は、当該機能又は用途の記載を盛り込んで併せて特定することができる｡但し、単なる純粋な機能又は純粋な用途のみによって化合物を特定することは許されない。原則として、化合物の名称は、通用される命名法に基づいて命名しなければならず、曖昧模糊とした用語を用いてはならない。

特許出願に係る発明が化合物の結晶物である場合、原則として、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が特許出願に係る発明と先行技術との区別を十分認定することができるように、請求項は、その技術的特徴を有する物理的、化学的特性、例えば X 射線粉末回折、単結晶 X 射線回折、IR、Raman、NMR 等のスペクトル分析法、又は DTA、TGA、DSC 等の熱分析方法における数値によってその結晶体構造を特定しなければならない。請求項を「化合物 X の多結晶型 A 型｡」として作成することは、当該多結晶型 A 型が任意の名称であって、技術的特徴についての記述がないため、不明確である。

4.2.1.2 医薬組成物に関する請求項

医薬組成物に関する請求項は、組成物の成分又は成分及び含有量等の組成特徴によって表すと共に、適切な接続詞、例えば開放形式、閉鎖形式及び半開放形式等の表現方式を用いなければならない。接続詞の表現方式及びその意味については、第一章 2.3.3「接続詞」を参照のこと。

発明の特徴又は改良が成分自体にのみ限られ、即ち発明が解決しようとする技術課題が特定の成分を選択することであり、成分の含有量がその発明の所属する技術分野における通常の知識を有する者が出願時の通常の知識に基づいて又は簡単な実験によって確定することができる場合は、請求項において成分のみを特定することができる。反対に、発明の特徴又は改良が成分のみに限られず、尚且つ含有量と関係があり、即ち発明が解決しようとする技術課題が特定の成分を選択することにあるのみならず、その成分の特定含有量をも確定しなければならない場合は、その必要な技術的特徴を明確に特定するように、請求項において成分及び含有量を同時に記載しなければならない。

医薬組成物に関する請求項は、当該医薬用途が機能性用語又は定義のみによって治療しようとする症状を特定しており、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者がそれに包括される具体的な疾病が何であるかを理解することができない場合、原則として当該請求項は不明確である。明細書において実験テスト又はテスト基準に関わる指示が提供されている、又はその発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が出願時の明細書に開示された内容に基づいて、出願時の通常の知識を参酌することによって当該用語又は定義が１つ又はそれ以上の具体的な疾病の名称に対応していると判断することができない限り、当該請求項は明確とは言えない。例えば、請求項に特定された疾病が「特定の受容体に対する選択的占有によって改善又は預防することができる任意の疾病」である場合、出願時の通常の知識及び出願時の明細書に開示された内容からでは具体的な疾病が何であるかを理解することができない場合、当該請求項に特定された範囲は不明確である。

「医薬組成物」を出願の標的とする場合、記載される技術的特徴が例えば同一成分の間隔投与、異なる成分を前後して使用することといった投与方法であるとき、標的の「組成物」とは一致せず、発明の実質的技術内容に応じて、例えば「キット」又は「用途」といった適切な標的を使用しなければならない。例えば特許出願に係る発明が「化合物 A の初期投与量として 5.0～10.0mg/kg で投与し、投与を 2 日間停止し、再度 2.0～5.0mg/kg の投与量で 3 日間投与し、順次循環的に投

与することを特徴とする、化合物 A による疾患 Y の治療。」である場合、医薬組成物を出願の標的とするべきではなく、「用途」を出願の標的として「化合物 A の初期投与量として 5.0～10.0 mg/kg で投与し、投与を 2 日間停止し、再度 2.0～5.0mg/kg の投与量で 3 日間投与し、順次循環的に投与することを特徴とする、化合物 A を疾患 Y を治療する薬物の製造に用いる用途。」に補正しなければならない。

特許出願に係る発明を「化合物 X 及び希釈剤、賦形剤又はキャリアを含むことを特徴とする医薬組成物。」として作成し、当該組成物の技術的特徴が活性成分 X であり、希釈剤、賦形剤又はキャリアについてはその発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が選択したり又は一般的な実験によって決めたりすることができ、当該希釈剤、賦形剤又はキャリアの種類を更に特定する必要がない場合、当該請求項は明確である。

原則として、請求項において、数字定量的な表示方式の代わりに文字定性的な記述を用いることについては、その意義が明瞭明確であり、且つその発明が所属する技術分野における通常の知識を有する者にとって従来技術である場合は、受け入れられる。例えば、請求項において、「治療有効量」によって新規な活性成分の含有量を特定することは明確である。反対に、「治療有効量」によって既知の活性成分を特定し、当該用語を先行技術との唯一の区別とした場合、保護を請求する範囲を特定することができないため、明細書において、当該治療有効量をどのようにテストするのかに関する教示又は当該技芸に基準テスト方法があることに関する説明がない限り、不明確である。

請求項において生成物の純度について述べることでは、当該物質を「医薬生成物とする」ことのみを特定することはできず、当該純度を表示する具体的な数値がなければ、不明確となる。

4.2.1.3 医薬用途に関する請求項

医薬用途に関する請求項において述べられた医薬用途は明確でなければならず、例えば「式 I で表される化合物を糖尿病を治療する薬物の製造に用いる用途。」、「β アミロイドペプチドの放出を抑制する医薬組み合わせ物の製造に用いることを特徴とする、式 I で表される化合物の用途。」のように、適用される疾病の名称又は薬理機序によって特定することができる。新規な医薬用途を特定するための用語が明確でなければならないことについては、本章 4.2.1.2「医薬組成物に関する請求項」を参照のこと。

例 1.

〔特許請求の範囲〕

X 受容体を活性化することができる化合物を含むことを特徴とする、肥満を抑制する医薬組み合わせ物。

〔説明〕

明細書には、新規な X 受容体及び X 受容体を活性化する能力を有する化合物をスクリーニングする方法と、当該化合物が肥満を抑制する効果を奏することを発見したことが開示されている。

明細書には、化合物が X 受容体を活性化することができるか否かを検査する方法を含む、X 受容体を活性化することができる化合物のスクリーニングの詳細が開示されており、当該方法によってスクリーニングすることで X 受容体を活性化することができる新規な化合物 A、B、C を得る実施例が記載されており、尚且つ A、B、C が X 受容体を活性化する効果が確認されている。しかしながら、A、B、C 以外の新規な化合物の化学構造又は製造方法は一切記載されていない。

〔結論〕

X 受容体は出願人が初めて発見したものであり、出願時の通常の知識を考慮しても、当業者は、X 受容体の活性作用を有する具体的な化合物を推測することができないことから、発明の範囲は不明確である。出願人が、例えば当該化合物を A、B、C に限定するよう特許請求の範囲を補正して、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が特許請求の範囲の特定内容から、また出願時の通常の知識を参酌することで、X 受容体の活化能力を有する新規な化合物を確認することができる場合は、上記拒絶理由を解消することができる。

例 2.

〔特許請求の範囲〕

H_2 遮断剤を抗アレルギー剤の製造に用いる用途。

〔説明〕

明細書には、従来の H_2 遮断剤の新規な用途に関し、出願前の先行技術には H_2 遮断剤が抗アレルギーの効果を奏することは開示されていない旨開示されている。しかしながら、出願時において既に H_2 遮断剤として用いることができる化合物が多く知られており、例えばシメチジン（cimetidine）、ラニチジン（ranitidine）、ファモチジン（famotidine）及びロキサチジンアセタート（roxatidine acetate）などが挙げられる。

〔結論〕

請求項に係る「H_2 遮断剤」は、含まれる活性成分が具体的に特定されていないものの、出願時の通常の知識に基づいて、「H_2 遮断剤」の具体的な活性成分が何であるかを理解することができるため、当該請求項の範囲は明確である。

4.2.2 簡潔であること

簡潔であることに関する審査については、第一章 2.4.2「簡潔であること」を参照のこと。

4.2.3 明細書に支持されること

化合物に関する請求項は、その特許請求の範囲が明細書によって支持されるか否かを考慮しなければならない。即ち、明細書に開示された内容に基づいて、常套的な実験又は分析方法を利用することで、明細書に記載された内容を請求項の範囲にまで十分に拡大することができるか否か、又は明細書に開示された内容が明らかな修正を施すだけで得られるものであるか否かを考慮しなければならない。例えば、複数の選択肢を有するマーカッシュ形式（Markush-type）で記載された化合物に関する請求項の場合、明細書において選択肢の特定構造を含む化合物について、少数の具体的な実施例のみ記載されるに過ぎず、当該選択肢のその他の構造を含む化合物について、明細書に開示された内容及び出願時の通常の知識に基づいて、常套的な実験方法を利用して又は明らかな修正を施すだけでは得ることができないときは、特許出願に係る化合物は明細書に支持され得ない。

医薬組成物又は医薬用途に関する請求項の場合、請求される範囲に化合物及びその誘導体が含まれ、明細書では化合物自体の医薬用途の実施形態又は実施例のみが提供され、誘導体の医薬用途の実施形態又は実施例が提供されていないときは、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が、単に化合物の実施形態又は実施例のみから、その他の可能な誘導体がいずれも主張される医薬用途を達成できることを拡大して知ることができないため、明細書の開示は特許出願に係る発明を十分に支持することができない。医薬組成物又は医薬用途に関する請求項の場合、例えば特殊な受容体の拮抗剤というように単に機能のみで化合物群を特定したときは、明細書に支持され得るか否かに特に注意しなければならない。明細書において単にある種の機能性化合物中にある特定の疾患の治療に用いることができる化合物が存在することが例示されるに過ぎない場合は、当該治療効果が当該種類の化合物が有する特定活性と関係していることを証明するに足る証拠がない限り、この種のすべての機能性化合物がいずれも当該疾患の治療に用いることができることを意味しない。

例.

〔特許請求の範囲〕

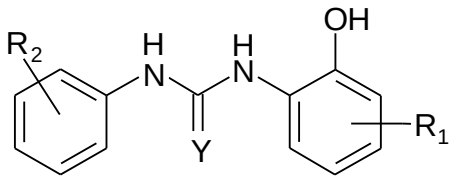
【請求項１】

IL-X 阻害作用を有する化合物を活性成分として含むことを特徴とする抗アレルギーの医薬組成物。

【請求項２】

IL-X 阻害作用を有する化合物は、一般式(I)で表される化合物であることを特徴とする請求項 1 に記載の抗アレルギーの医薬組成物。

【化１】



(I)

〔明細書〕

明細書には、IL-X 阻害作用を有する化合物を抗アレルギーの医薬組成物とすることが開示され、一般式(I)で表される化合物において、式中、Y は酸素原子又は硫黄原子であり、R1 及び R2 はそれぞれ水素、ハロゲン、ニトロ基、シアノ基及び C1-6 アルキル基から選ばれることも開示されている。実施例において、一般式(I)で表される化合物に含まれた複数の具体的な化合物が、抗アレルギーの作用を有することが確認される。しかしながら、明細書にはその他 IL-X 阻害作用を有する化合物も抗アレルギー作用を有する理論的又は実験上の根拠は開示されておらず、出願時の通常の知識にも IL-X 阻害作用を有する化合物が抗アレルギー作用を有することは確認されていない。

〔結論〕

請求項 1 は、予期される「IL-X 阻害活性」の性質によって特定される化合物を活性成分とする抗アレルギーの医薬組成物に関する。請求の範囲には当該性質を有する化合物が含まれるが、但し明細書には、請求項 2 において特定される一般式(I)で表される化合物しか開示されておらず、それは請求項 1 が請求する範囲における化合物の極少数である。更に、明細書では、請求項 2 の一般式(I)で表される化合物に含まれる少数の具体的な化合物が抗アレルギーの効果を有することしか確認されておらず、IL-X 阻害作用を有するその他の化合物も抗アレルギー作用を有する理論的又は実験上の根拠は開示されていない。従って、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者は、出願時の通常の知識に基づいても、その有効性を確認又は推論することができず、且つ常套的な実験又は分析方法を利用すれば拡大することができるものではない。従って、請求項 1 は、明細書に支持されるこ

とができない。

4.2.4 審査に関する注意事項

(1)医薬用途に関する請求項について、薬理機序によってその薬物を製造する用途を特定する場合、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が、当該薬理機序について出願時の通常の知識を参酌することで、実質的に対応する1つ又はそれ以上の具体的な疾病の名称を得ることができることによって、初めて請求項が明確であると認定することとし、さもなければ、当該請求項は不明確であり、また、明細書によって支持され得ない問題も有し得る。

(2)従属項の従属部分について、従属される請求項の完全な標的名称を明記しなければならない。さもなければ、請求項が不明確又は従属関係が不適切となる。例えば、独立項である請求項1の標的名称が「……化合物及びその異性体、水和物。」である場合、その従属項である請求項2には、「……請求項1に記載の化合物及びその異性体、水和物。」と記載しなければならず、単に「……請求項1に記載の化合物。」とのみ記載してはならない。

5.特許要件

5.1 産業上の利用可能性

専 22. I 前

医薬生成物の発明は、明細書において生成物が恐らく有用であることを大雑把に説明するのみとするのではなく、明細書において当該生成物の医薬用途を具体的に明示しなければならない。例えば、明細書において、請求する化合物が不特定の疾患の治療に用いることができること又は当該化合物が有用な生物特性を有することを記載するだけでは、その発明が産業上の利用可能性を有することを十分証明することはできない。中間体の産業上の利用可能性は、その最終生成物によって認定されるため、最終生成物の用途を記載しなければならない。

5.2 新規性

5.2.1 化合物に関する請求項

専 22. I

特許出願に係る発明が化合物である場合、引用文献に既に化合物の(i)化学名称、(ii)分子式（又は構造式）、(iii)物理化学パラメータ等の性質及び／又は(iv)製造方法（原料含む）が明記されており、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が、当該文献の開示内

容及び出願時の通常の知識との結合に基づいて、当該化合物を製造又は分離することができるときは、当該化合物は新規性を有しない。但し、引用文献においてその存在が説明される又はその名称若しくは化学式が言及されるに過ぎず、当該化合物を如何にして製造・使用するかについて説明がなされておらず、且つその発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が当該文献の内容又は当該文献公開時に得ることができた通常の知識からでは当該化合物を如何にして製造又は分離するかを理解することができない場合は、当該文献を基に当該化合物が新規性を有しないと認定することはできない。

原則として、上位概念の発明の公開は、下位概念の発明の新規性に影響を及ぼさない。従って、引用文献に開示された化合物の化学一般式によって、特許出願に係るその一般式における１つの具体的な化合物が新規性を喪失することはない。例えば、低級アルキル基（lower alkyl）の開示によってエチル基（C_2H_5）が新規性を喪失することはない。しかしながら、先行技術が下位概念の発明であり、且つその内容において、当該先行技術に開示された技術手段がその属する上位概念の発明に適用可能であることが既に教示又は推奨されている場合は、下位概念の発明の公開によって当該下位概念が属する上位概念の発明は新規性を喪失する。例えば、１つの具体的な化合物の公開によって、当該具体的な化合物を含む一般式を有する発明は新規性を喪失するが、当該一般式に含まれる当該具体的な化合物以外の他の個別の化合物の新規性には影響を及ぼさない。

用途で化合物を特定した請求項は、通常、単なる当該物の用途又は使用方法についての記述に過ぎず、その特許請求の範囲は化合物自体であって、用途の限定がなされていないと認定しなければならない。例えば、「条虫駆除剤に用いられる」では単に化合物の用途を示すに過ぎないため、「条虫駆除剤に用いられる化合物 A」と、用途が特定されていない既知の化合物 A とに違いはない。従って、「条虫駆除剤に用いられる化合物 A」は新規性を有しない。

5.2.1.1 異性体、溶媒及び化合物又は結晶体

化合物 A は、引用文献に公開されているものの、引用文献の内容が、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者がその光学異性体、溶媒及び化合物又は結晶体を製造・使用することができる程度まで開示されていない場合、その光学異性体、溶媒及び化合物又は結晶体は新規性を有する。

特許出願に係る発明が既知の化合物の鏡像異性体（enantiomer）であり、引用文献に当該化合物のラセミ混合物（racemic mixture）が公開

されているものの、各種光学異性体は具体的に公開されておらず、実際に当該化合物の各種光学異性体が客観的に存在し、単に個別に単離されているだけであるが、引用文献の内容が、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が当該鏡像異性体を製造・使用することができる程度まで開示されていない場合、特許出願に係る発明は新規性を有する。

引用文献において、ラセミ混合物が公開されているのみならず、且つ引用文献に当該鏡像異性体を製造する原料及び方法が記載されていることによって、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が当該鏡像異性体を製造・使用することができる場合、当該鏡像異性体は新規性を有しない。

5.2.1.2 化合物の選択発明

選択発明は、１つの既知であり且つより大きな１つの群れ又は範囲の中から選ばれた、先行技術において明確に開示されていない個別の成分（element）、サブセット（sub-sets）又はサブレンジ（sub-ranges）に関する発明である。

化合物の選択発明の新規性を判断するに当たっては、選ばれた化合物が先行技術において個別の具体的な形式によって開示されているか否かを判断しなければならない。特許出願に係る化合物における特定の置換基が、先行技術の化学一般式における単一の置換基の群れから選ばれたものである場合は、新規性を有しない。例えば、先行技術において、ある化合物 X の化学一般式が開示されており、その置換基 R_1 が COOH、置換基 R_2 が Cl、SO_3H、CH_3、……、$CH_2CH_2CH_3$ のグループから選ばれ、もし特許出願に係る発明が、置換基 R_1 が COOH であり且つ置換基 R_2 が $CH_2CH_2CH_3$ である化合物である場合、当該具体的な化合物は先行技術に既に公開されているため、新規性を有しない。しかしながら、もし特許出願に係る化合物が、先行技術における特定範囲の２つ又は複数の置換基の群れの中からそれぞれ選ばれた特定の置換によって生成された場合、それは特徴を達成するための特定の組み合わせであって、当該組み合わせが先行技術に特定して具体的に開示されていない場合は、新規性を有する。例えば、先行技術に一般式で表される化合物 X が開示され、その置換基 R_1 が COOH、NH_2、……、Phenyl のグループであり、置換基 R_2 が Cl、SO_3H、CH_3、……、$CH_2CH_2CH_3$ のグループから選ばれる場合、特許出願に係る発明が置換基 R_1 が COOH であり、置換基 R_2 が $CH_2CH_2CH_3$ である化合物であるときは、先行技術に R_1 及び R_2 の数多くの選択肢から置換基 COOH 及び $CH_2CH_2CH_3$ の組み合わせを特定して選ぶことが具体的に開示されて

いないことによって生成されたその個別の化合物は、新規性を有する。

5.2.2 医薬組成物に関する請求項

医薬組成物は、特定の性質を有する１つの化合物又は化合物群からなる。従って、医薬組成物の新規性の判断に当たっては、主としてその１つの化合物又は化合物群について考慮しなければならない。医薬用途で組成物を特定する発明については、通常、当該組成物が適用される疾病、当該組成物の薬理機序又は使用方法に対する記述に過ぎず、その特許請求の範囲が組成物自体であると認定しなければならず、記載された用途は当該発明が新規性又は進歩性を満たすか否かの判断には作用を及ぼさない。

5.2.2.1 医薬組成物に関する新規性判断の原則

5.2.2.1.1 特定性質を有する１つの化合物又は化合物群

特許出願に係る医薬組成物を先行技術に開示された組成物と比べた場合、そのうちの特定性質を有する１つの化合物又は化合物群が異なるときは、請求される医薬組成物の発明は新規性を有する。

5.2.2.1.2 特定の疾患への適用に関する医薬用途

特許出願に係る医薬組成物に含まれる特定性質を有する化合物が引用文献における化合物と同一であり、特許出願に係る医薬用途と引用文献における化合物の性質によって生じる医薬用途とが異なるに過ぎない場合、特許出願に係る医薬組成物は新規性を有しない。但し、請求される発明は、用途の請求項による出願に変更することができる。例えば、特許出願に係る発明に「有効量の化合物 A を含むことを特徴とする、疾患 Z を治療するための医薬組成物。」が開示され、引用文献に「有効量の化合物 A を含むことを特徴とする、疾患 X を治療するための医薬組成物。」が開示されている場合、出願時に属する技術分野における通常の知識によって疾患 Z と疾患 X とが異なる疾患であることを判断するが、化合物 A が既知であるため、請求される医薬組成物は新規性を有しない。但し、請求される発明が、例えば「疾患 Z を治療する医薬組成物の製造に用いられることを特徴とする、化合物 A の用途。」のように、医薬用途に関する請求項に補正されれば、引用文献に対して新規性を有する。

5.2.3 医薬用途に関する請求項

化合物又は組成物が新規性を有する場合、その医薬用途に関する請求項は当然新規性を有する。例えば、化合物 A が新規性を有する場合、「化合物 A の薬物としての用途。」は当然新規性を有する。化合物又は組成物が新規性を有しない場合、その医薬用途に関する請求項が新規性を有するか否かは、使用される化合物又は組成物について主張される医薬用途によって判断する。当該医薬用途は、通常、適用される疾病の名称又は薬理作用を指すが、発明の技術的特徴が既知の組成物を既知の疾病又は薬理作用に用いることであって、新たな治療の応用として、例えば特定患者群、特定部位、投与量、投与経路、投与間隔及び異なる成分を前後して服用すること等の技術的特徴を別途提出し、そのいずれか１つの技術的特徴が先行技術と明確に区別できさえすれば、当該医薬用途に関する請求項は新規性を有する。例えば組成物 B が新規性を有しない場合、「疾患 X を治療する薬物の製造に用いられることを特徴とする医薬組成物 B の用途。」が新規性を有するか否かについては、組成物 B の疾患 X の治療における用途が新規性を有するか否かによって判断する。引用文献をもってある化合物又は組成物の医薬用途における新規性を拒絶する場合、引用文献における当該医薬用途の記載は、通常、十分に開示され、それに基づいて実施できる程度まで達している必要がある。試験管内又は動物モデルで行う薬理効果又は観察によって得られた行為効果は、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者にとって直接且つ一義的に当該医薬用途を反映し得るものであれば、いずれも十分にその医薬用途が新規性を有しないことを証明する証拠とすることができる。審査官は、当該化合物又は組成物が特定疾患の治療に用いられることに関する陳述はあるものの確実な臨床データは記述されていない引用文献を用いてその新規性を拒絶することができる。しかしながら、当該文献の陳述が、十分に開示されそれに基づいて実施可能な程度まで達しているか否かに注意しなければならない。

異なる医薬用途に属するか否かの考慮においては以下に注意しなければならない。

(1)たとえ特許出願に係る医薬用途が引用文献に開示された医薬用途とは表現方式が異なっていたとしても、出願時の通常の知識を考慮して、特許出願に係る医薬用途が以下のいずれかの状況に該当する場合は、依然として新規性を有しない。

(i)特許出願に係る医薬用途が、引用文献に開示された医薬用途における同一の薬理機序によって直接且つ一義的に導き出され得る場合。例えば、引用文献に気管支拡張剤を製造する用途が開示され、

特許出願に係る医薬用途に喘息治療剤を製造する用途が開示されていること；引用文献に血管拡張剤を製造する用途が開示され、特許出願に係る医薬用途に血圧降下薬を製造する用途が開示されていること；引用文献にヒスタミン H_2 受容体抑制剤を製造する用途が開示され、特許出願に係る医薬用途に胃潰瘍治療剤を製造する用途が開示されていること等。

(ii)特許出願に係る医薬用途が、密接に関連する薬理効果から不可避的に生じる場合。例えば、引用文献に強心剤を製造する用途が開示され、特許出願に係る医薬用途に利尿剤を製造する用途が開示されていること；引用文献に消炎剤を製造する用途が開示され、特許出願に係る医薬用途に鎮痛剤を製造する用途が開示されていること。

(2)特許出願に係る医薬用途が上位概念の発明であり、引用文献に開示された医薬用途が特許出願に係る発明の下位概念の発明である場合、特許出願に係る医薬用途は新規性を有しない。例えば、引用文献に抗精神病薬を製造する用途が開示され、特許出願に係る医薬用途に中枢神経作用薬を製造する用途が開示されていること；引用文献に肺癌治療薬を製造する用途が開示され、特許出願に係る医薬用途に抗癌剤を製造する用途が開示されていること。

(3)引用文献に開示された医薬用途において、特許出願に係る医薬用途が当該引用文献に開示された医薬用途を発見した薬理機序であり、それを新たな医薬用途として主張し、且つこの２種類の用途が実質的に区別できない場合、特許出願に係る医薬用途は新規性を有しない。例えば、引用文献に抗菌剤を製造する用途が開示され、特許出願に係る医薬用途に細菌細胞膜形成阻止剤を製造する用途が開示されていること。

5.2.4 審査に関する注意事項

特許出願に係る発明が、疾患 Y を治療するためのキット、包装である場合は、活性成分としての化合物 X 及び取扱説明書（instruction）（又は指示、使用説明書又は投与説明書）を含む。化合物 X を疾患 Y の治療に用いる医薬用途が既知であり、且つその請求項の内容における、先行技術との唯一の相違点が当該取扱説明書である場合、当該取扱説明書は単なる情報の提示に過ぎず、特許出願に係る発明をそれによって先行技術と区別することができないため、特許出願に係る発明は新規性を有しない。

5.3 進歩性

5.3.1 化合物に関する請求項

特許出願に係る化合物の構造が既知の化合物の構造と類似していない場合、それが予期できない効果を有しているか否かを問わず、当該特許出願に係る化合物は進歩性を有する。

特許出願に係る化合物の構造が既知の化合物と類似しており、且つ当該既知の化合物と類似の用途を有する場合、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が、構造が類似する化合物が類似する性質を有することを合理的に予期することができるため、原則として、当該特許出願に係る化合物は進歩性を有しない【専 22.II】。但し、特許出願に係る化合物が予期できない効果を有する場合は、当該特許出願に係る化合物は進歩性を有する。この予期できない効果は、当該既知の化合物とは異なる用途であってもよく、既知の化合物に比べてより優れた効果であってもよい。

5.3.1.1 構造類似性の判断原則

２種類の化合物の構造が類似であるか否かの判断にあたっては、主として分子構造自体を考慮する。一般的に、化合物の構造が近い程度は、強い順に、酸及びアルカリの塩類、幾何異性体（geometrical isomers）、位置異性体（position isomers）（同一原子の異なる位置に同一の置換基を有するもの）、同族体（homologues）（化合物の異なる箇所に、例えばアルキル基-CH_2-といった同一の置換官能基グループが規則的に連続して加えられたもの）。

２種類の化合物が構造上類似であるか否かは、その属する技術分野とも関係がある。審査の際には、異なる分野の特性を斟酌しなければならず、請求される化合物と既知の化合物とが類似した構造を有するか否かを単純に分子構造から推定することはできず、更にはその属する技術分野、構造及び効果の関係、適用範囲等の様々な要素をも考慮しなければならない。原則として、化合物の構造及び効果の関係が密切であればあるほど、構造類似性に関する判断基準は緩やかでなければならない。

5.3.1.2 鏡像異性体の進歩性

特許出願に係る発明が化合物の鏡像異性体（enantiomer）である場合、引用文献において当該化合物のラセミ混合物（racemic mixture）が既に公開されているときは、その発明の属する技術分野における通常の

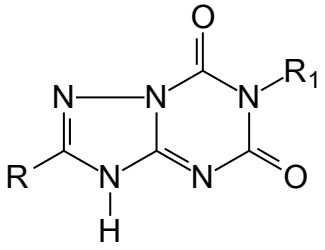
知識を有する者が各種光学異性体を製造できる程度まで具体的に公開されていなかったとしても、不斉炭素原子を有する化合物には一般的に光学異性体が存在することは、その発明の属する技術分野における通常の知識であり、且つ鏡像異性体が通常顕著な生物活性を有することは予期できることでもあり、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者は、通常、異性体を分離する一般的な方法を用いて、ラセミ混合物から鏡像異性体を分離させることを試みるものであるから、請求する鏡像異性体が予期できない効果を有していること、又は出願時の通常の知識及び技術では当該鏡像異性体を容易に製造することができないことを、出願人が証明することができない限り、原則として、当該発明に係る鏡像異性体は進歩性を有しない。

5.3.1.3 化合物の多結晶型の進歩性

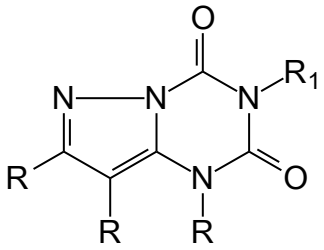
特許出願に係る発明が既知の化合物の多結晶型である場合、多結晶型の分子構造が当該化合物と完全に同一であり、結晶形態に相違があるに過ぎず、且つ多結晶型が、通常、常套的な実験方法によって得られるものであるため、当該多結晶型が当該既知の化合物に比べて予期できない効果を有しない限り、原則として、既知の化合物の多結晶型は進歩性を有しない。また、引用文献において既知の化合物の多結晶型 A 型が既に公開され、特許出願に係る発明が当該化合物の他の多結晶型 B 型である場合、通常は、先行技術において他の多結晶型の存在が予期されているか否か、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が当該多結晶型の製造を試みる動機を有するか否か、及び他の多結晶型を如何にして製造するかが理解されているか否か、当該多結晶型が他の多結晶型とは異なる又は増強する性質(例えば生物学的利用能、安定性等)を有しているか否かを更に考慮しなければならない。

例 1.

引用文献：化合物 1a



特許出願に係る発明：化合物 1b



〔説明〕

構造が類似する化合物は同一の基本的な核心部分又は基本的な環を有しなければならないが、特許出願に係る化合物 1b は、構造が引用文献に開示された化合物 1a とは類似しないため、進歩性を有する。

例 2.

引用文献：化合物 2a　　$H_2N－C_6H_4－SO_2NHR^1$

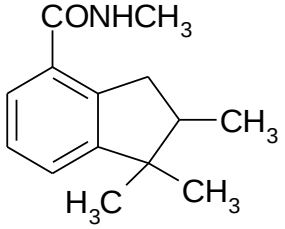
特許出願に係る発明:化合物 2b　$H_2N－C_6H_4－SO_2－NHCONHR^1$

〔説明〕

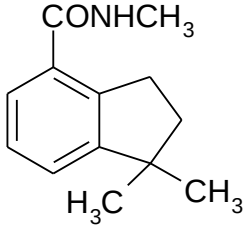
引用文献において化合物 2a のスルファニルアミドが抗菌に用いられることが開示されており、特許出願に係る化合物 2b のスルホニル尿素は糖尿病の治療に用いられ、この２つの化合物は構造こそ類似しているものの、薬理作用は異なっているため、特許出願に係る化合物 2b は進歩性を有する。

例 3.

引用文献：化合物 3a



特許出願に係る発明：化合物 3b



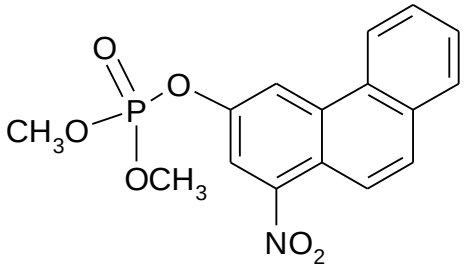
〔説明〕

引用文献に開示された化合物 3a と特許出願に係る化合物 3b とは構造が類似しており、且ついずれも同一の静菌効果を有するが、両者を

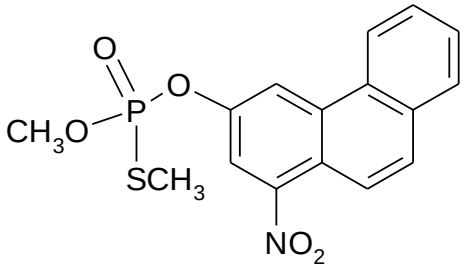
共に 0.002%の濃度で 3 日間使用した後、引用文献の化合物 3a の静菌効果が 30%であったのに対し、特許出願に係る化合物 3b の静菌効果は 90%にも達しており、予期できない効果を生じていることから、特許出願に係る化合物 3b は進歩性を有する。

例 4.

引用文献：化合物 4a



特許出願に係る発明：化合物 4b



〔説明〕

引用文献に開示された化合物 4a と特許出願に係る化合物 4b とは構造が類似しており、SCH_3 と OCH_3 の違いしかなく、且つ予期できない効果を生じていないことから、特許出願に係る化合物 4b は進歩性を有しない。

5.3.1.4 化合物の選択発明

選択発明に係る出願の標的の先行技術との相違点は、それが先行技術における既知のより大きな群れ又は範囲の中から、特定的に開示されていない個別成分、サブセット又はサブレンジを意図的に選択した発明であることである。その選ばれた発明が先行技術に特定的に開示されておらず、且つ先行技術に比べて予期できない効果を生じることができる場合は、当該発明が容易に完成できるものではなく、進歩性を有すると認定しなければならない。

(1)選択発明が進歩性を有しない状況

特許出願に係る発明が、単に既に開示された広い範囲の化合物の中から選ばれた特定の少数の化合物に過ぎず、且つ予期できない効果を有しない場合、当該発明は進歩性を有しない。例えば、先行技術にお

いて、一般式によって特定された化合物が開示され、当該一般式に R で表される置換基が含まれ、その範囲が「ハロゲン若しくはヒドロキシル基で置換された又は置換されていないアルキル基又はアリール基」のように、広く定義されたグループを包括しているものの、少数の具体的な実施例しか開示されていない。一方、特許出願に係る発明では、置換基 R で定義された既に先行技術に公開された広いグループの中から、例えばアリール基である１つの具体的な特定のグループが選ばれたが、先行技術にはアリール基が一切明確に開示されていない。ここで若し、その選択によって生成された化合物が先行技術の化合物に比べて予期できない効果を有することを示していない場合、又はこれら化合物が先行技術に明確に開示された化合物よりも優れた性質又は効果を有するにもかかわらず、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者がこれら化合物が当該性質又は効果を有することを予期することができ、このような選択を行うように導かれる可能性がある場合、特許出願に係る発明は進歩性を有しない。

(2)選択発明が進歩性を有する状況

特許出願に係る発明が、既に開示された広い範囲の化合物の中から選ばれた特定の少数の化合物であり、且つ予期できない効果を有する場合、当該発明は進歩性を有する。例えば、上述した(1)の置換された化合物のように、特許出願に係る発明が、先行技術において既に定義された置換基 R の全ての範囲内から特定のアリール基を選択して成るものであって、この選択によって生成された化合物が先行技術の化合物に比べて予期できない効果を有し、且つ先行技術には、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者に対して当該効果を得るためには当該特定の選択を行うのであってその他の選択ではないことが一切指示・教示されていない場合、特許出願に係る発明は進歩性を有する。

5.3.2 医薬組成物に関する請求項

5.3.2.1 人間以外の動物用医薬と人間用医薬の転用

特許出願に係る発明が、単に引用文献における１つの化合物又は化合物群からなる人間ではない動物のための同一又は類似の疾患に用いられる医薬を人間用医薬として転用するものである場合、予期できない効果等の理由又はその進歩性を証明し得る証拠を提出することができない限り、たとえ引用文献においてその転用が推奨されていなかったとしても、原則として特許出願に係る発明は進歩性を有しない。

5.3.2.2 二以上の成分を組み合わせて調製された組成物

特許出願に係る発明が二以上の既知の成分によって特定される場合、それら成分の組み合わせが新規であり且つ予期できない効果を生じるときは、特許出願に係る発明は進歩性を有する。

しかしながら、二以上の成分の組み合わせが、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が、例えば医療効果の増進又は副作用の低減といった医薬分野の従来の課題を解決するために、二以上の成分の最適な組み合わせを探すことを試み、且つ通常の常套的な作業における普通の手段によって獲得できるものである場合は、特許出願に係る発明は進歩性を有しない。

このような組み合わせの例を以下に示す。

(i)成分の主作用が同一である既知の成分の組み合わせ。

(ii)副作用を有する既知の主成分と当該副作用を解消することのできる既知の副成分との組み合わせ。

(iii)主な疾患から生じる種々の症状に対して相対的な治療効果を有する既知の成分の組み合わせ。

5.3.3 医薬用途に関する請求項

原則として、医薬用途に関する請求項の進歩性の判断方式では、使用された化合物等の活性成分及び主張された医薬用途について判断する。医薬用途は、通常、適用される疾病の名称又は薬理作用をいうが、但し発明の技術的特徴が、既知の組成物を既知の疾病又は薬理作用に用いることについて、新たな治療の応用を提出するものである場合、例えば特定患者群、投与量、投与経路、投与間隔、異なる成分を前後して服用すること等の技術的特徴である場合は、当該技術的特徴が進歩性を有するか否かについて考慮しなければならない。

例えば医療効果の増大若しくは副作用の減弱又は投与量、投与間隔、投与経路等の医薬品使用方式の最適条件の探索といった、医薬分野における通常の知識を有する者が直面する従来の課題を解決するために、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者が、通常の常套的な作業による普通の手段によって獲得することができ、且つ引用文献の開示内容と比べた際の効果を予期することができる場合は、進歩性を有しない。しかしながら、例えば引用文献の開示内容と比べて予期できない効果があるといった、その進歩性を推論することができる他の観点がある場合、特許出願に係る発明は進歩性を有する。

更に、特許出願に係る医薬用途が引用文献に開示された医薬用途との間で内容が異なっていたとしても、出願時の通常の知識から両者の

作用機序の関連性を推察することができる場合、予期できない効果等の理由又はその進歩性を証明し得る証拠を提供することができないかぎり、原則として、特許出願に係る医薬用途は進歩性を有しない。

6.医薬の組み合わせ、キット及び包装の発明

医薬分野において、２種類又は複数種の既知の成分の組み合わせ発明における出願の標的は、組成物であってもよく、組み合わせ、キット又は包装として特定されてもよい。「組み合わせ」を出願の標的とした場合、２種類以上の異なる成分を結合して使用することが含まれる。医薬における「キット」又は「包装」には、通常、１種類以上の活性成分及びその発明を実施するのに必要な必要素子が含まれる。２種類以上の成分を含む組み合わせ又はキットでは、その成分は通常、同時に若しくは連続して、又は特定の時間間隔で投与される。例えば、化合物 A 及び禁煙に用いられるのに有利な他の活性成分 B を含むことを特徴とする禁煙に用いられるのに有利なキットにおいて、当該化合物 A 及び当該活性成份 B は、個別の分割領域内において、また同一の又は異なる包装において、同時に、別々に又は連続して投与される。

組み合わせ、キット又は包装の進歩性について、先行技術とは異なる技術的特徴が異なる成分の組み合わせにしかない場合、その判断の原則は、5.3.2.2「二以上の成分を組み合わせて調製された組成物」の規定と同じである。

組み合わせの発明における２種類（又は複数種）の成分が体内におけるその従来の一般的機能しか実行せず、２種類（又は複数種の）成分同士の間に相乗効果（synergistic effect）が生じない場合、当該請求項は進歩性を有しない。また、このような組み合わせが、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者にとっては自明であって容易に完成できるものであり、それによって生じる相乗効果も予期することができる場合、当該組み合わせは進歩性を有しない。特に２種類のタイプの活性剤を組み合わせて使用することが、その発明の属する技術分野における通常の知識を有する者にとって従来の技術である場合（例えば鎮痛剤（analgesic）及び充血除去剤（decongestant）を組み合わせた使用）、発明の特徴が、そのうちの１つのタイプの活性剤（例えば鎮痛剤）から選ばれた新規な、より効果の高い成分を他のタイプの活性剤（例えば充血除去剤）と組み合わせるに過ぎないときは、原則として、このような組み合わせは進歩性を有しない。

発明における先行技術とは異なる技術的特徴が、特定の時間間隔で、同時に又は連続して２種類又はより多くの異なる成分を服用することにあり、組み合わせ、キット又は包装が出願の標的である場合、原則

として、先行技術と区別できるように、その請求項は上述した技術的特徴で特定されなければならず、且つ明細書に支持されなければならない。

7.発明の単一性

単一性の判断については、まず第四章における発明の単一性の規定を参考されたい。ここでは、医薬化学関連発明の特殊な状況について説明する【専 31】。

7.1 化合物に関する請求項

7.1.1 マーカッシュ形式の請求項

マーカッシュ形式の択一表現形式で特許請求の範囲を特定した場合、択一形式による各選択肢（alternatives）が類似の性質（nature）を有するときは、各選択肢が技術上相互に関連し、同一の又は対応する特別な技術的特徴を有しており、発明の単一性を有すると認定する。

マーカッシュ形式の択一表現形式で化合物の発明を特定した場合、その列記された各選択肢（即ち選択に供される化合物）が類似の性質を有するか否かを判断するときは、以下の条件を同時に満たしているか否かを考慮しなければならない。

(1)すべての選択肢が共通の性質又は活性を有している。

(2)(a)すべての選択肢が共通の構造を有する。即ち、すべての選択肢が１つの重要な化学構造要素（element）を共有している。又は(b)共通の構造に統一的な判断基準はないものの、すべての選択肢がその発明の属する技術分野における通常の知識を有する者によって「公認された化合物群」に属すると認定され得る。

上述した(2)(a)における「すべての選択肢が１つの重要な化学構造要素を共有する」とは、すべての選択肢のいずれもが共通の化学構造を有しており、当該共通の化学構造がその構造の大部分を占めていること、又は当該化合物の共通の化学構造がその化学構造の一部分を占めるに過ぎないものの、先行技術から考えて、当該共通の構造部分が構造上独特な部分を構成していることをいう。当該化学構造要素は、単独の一部分（component）であってもよく、いくつかの独立部分が接続されてなる組み合わせであってもよい。

上述した(2)(b)の「公認された化合物群」とは、その発明が属する技術分野における通常の知識に基づいて、その発明の要素が特許出願に係る発明に対して、同一作用を有する同一種類の化合物群であること

を予想することができることをいう。換言すれば、この化合物に属する各化合物は、いずれも互いに代替可能で同一の結果が得られることを予期することができるものである。

マーカッシュ形式の請求項における、少なくとも１つの選択肢が先行技術に既に公開されていることを発見した場合は、当該請求項が発明の単一性を有するか否かを改めて考慮しなければならない。

7.1.2 中間体及び最終生成物

中間体及び最終生成物に係る発明は、以下２つの条件(a)及び(b)を同時に満たしている場合、発明の単一性を有する。

(a)中間体及び最終生成物が同一の基本構造要素を有している。

(i)中間体及び最終生成物の基本化学構造が同一であるか、又は、

(ii)２種類の生成物の化学構造が技術的に密切に関連していて、当該中間体によって１つの基本構造要素が最終生成物に導入されている。

(b)中間体及び最終生成物が技術的に相互に関連していて、最終生成物が中間体から直接製造されたものである、又は中間体から直接分離されたものである。

同一出願案件において、同一の最終生成物を製造するための異なる方法において用いられる異なる中間体を請求している場合は、これら中間体が同一の基本構造要素を有していさえすれば、発明の単一性を有する。

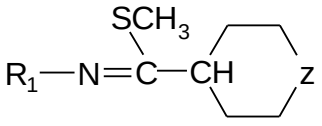
同一出願案件において、同一の最終生成物の異なる構造部分における異なる中間体を請求している場合は、発明の単一性を有しない。

例 1.マーカッシュ形式：共通の構造

〔特許請求の範囲〕

下記構造式を有することを特徴とする化合物。

【化１】



（式中、R_1は、フェニル基、ピリジン基、チアゾリル基、トリアジン基、チオアルキル基、アルコキシ基及びメチル基から選ばれ、Z は、酸素、硫黄、イミド基及びメチレン基から選ばれる。）

〔説明〕

この例において、イミド基-N=C-SCH_3が六員環に接続する構造は、

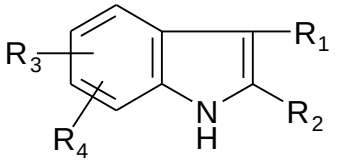
すべての選択肢が共有する重要な構造要素であり、且つ先行技術に対して貢献をなす特別な技術的特徴である。請求されるすべての化合物について、腰痛を和らげる薬物として用いることができるという同一の効果が主張されているため、請求項に係るすべての化合物同士の間に同一の又は対応する特別な技術的特徴を有しており、本願は発明の単一性を有する。

例 2.マーカッシュ形式：共通の構造

〔特許請求の範囲〕

下記構造式を有することを特徴とする化合物。

【化１】



（式中、R_1は、フェニル基、ピリジン基、チアゾリル基、トリアジン基､チオアルキル基､アルコキシ基及びメチル基から選ばれ、R_2-R_4はそれぞれメチル基、トリル基及びフェニル基から選ばれる。）

〔説明〕

この例において、請求されるすべての化合物が血液の酸素吸収能力を向上させる薬物としての同一の効果を有する。インドリル基の部分はすべての選択肢が共有する重要な構造要素となっているが、しかしながら、インドリル基の構造は既知であり、先行技術に対して貢献をなす特別な技術的特徴ではないため、請求項に係るすべての化合物同士の間に同一の又は対応する特別な技術的特徴を有しておらず、本願は発明の単一性を有しない。

例 3.マーカッシュ形式：共通の構造をもたない

〔特許請求の範囲〕

下記一般式で表される化合物 A-B-C-D-E において、

A は、C_1-C_{10}アルキル基又はC_2-C_{10}アルケニル基又はC_3-C_{10}ナフタレン基、置換又は非置換のアリール基、又は O 及び N ヘテロ原子から選ばれる 1～3 個のC_5-C_7複素環から選ばれ、

B は、C_1-C_6アルキル基又はC_2-C_6アルケニル基又はC_2-C_6アルキニル基、アミノ基、スルホン酸基、C_3-C_8エーテル又はチオエーテルから選ばれ、

C は、O、S 又は N ヘテロ原子から選ばれる 1～4 個のC_5-C_8飽和

又は不飽和複素環、又は、置換又は非置換のフェニル基から選ばれ、
D は、B 又は C_4-C_8 カルボキシ基又はアミド基から選ばれ、
E は、置換又は非置換のフェニル基、ナフチル基、インデニル基、ピリジン基又はオキサゾリル基から選ばれることを特徴とする化合物 A-B-C-D-E。

〔説明〕

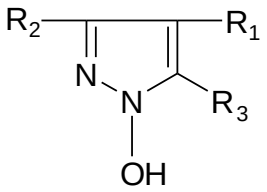
上述した一般式では主な構造要素が何であるかを確定することができないことから、すべての選択肢同士の間に共通の構造がなく、その特別な技術的特徴を確定することができないため、請求項に係るすべての化合物同士の間には同一の又は対応する特別な技術的特徴がなく、本願は発明の単一性を有しない。

例 4.中間体/最終生成物

〔特許請求の範囲〕

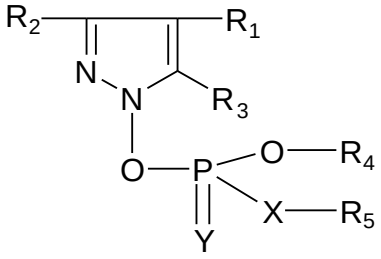
【請求項１】

下記構造式を有することを特徴とする化合物。



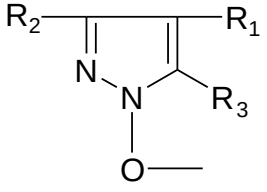
【請求項２】

下記構造式を有することを特徴とする化合物。



〔説明〕

中間体及び最終生成物の化学構造には技術的に密切な関連性が存在しており、最終生成物に導入された基本構造要素は、以下のとおりである。



従って、請求項 1 及び請求項 2 同士の間に同一の又は対応する特別な技術的特徴を有しており、発明の単一性を有する。

7.2 医薬組成物に関する請求項及び医薬用途に関する請求項

医薬組成物及び医薬用途に関する請求項に特定された医薬用途が、異なる種類の疾患を対象とするものである場合は、１つの広義の発明概念に属するものであるか否かに注意しなければならない。即ち、例えば、請求項に包括される疾病が互いに関連している（且つ請求項に係る既知の疾病とは関係がない）か、又はこれら疾患の治療若しくは診断が共通する作用機序に属するものである等、同一の又は対応する特別な技術的特徴を有して初めて特許出願に係る発明が発明の単一性を有すると認定される。